

WO 2006/054366 A1

明 細 書

軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩を用いたアミノ酸およびその
誘導体の製造方法

5

技術分野

本発明は、軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩を相間移動触媒
として用いた光学活性な α -アミノ酸およびその誘導体の製造方法に関する。

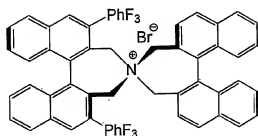
10 背景技術

式 $H_2NCH(R)COOH$ で表される α -アルキル- α -アミノ酸は、
天然に存在する非常に重要なアミノ酸である。 α -アルキル- α -アミノ酸
の大部分は、 α 位炭素においてL立体配置を有するL体として、動物、植物、
微生物などに存在し、このL体はポリペプチド鎖を構成し得る。一方、D体
15 は、植物、菌類、微生物中に非タンパク性の化合物として存在している。こ
れらの α -アルキル- α -アミノ酸に対して、立体化学的に安定な炭素中心
を有し、そしてペプチドに組込まれ得る α 、 α -ジアルキル- α -アミノ酸
は、特別な役割を果たすことで近年注目されている化合物である（Bellier,
B.ら、J. Med. Chem., 1997, Vol. 40, p. 3947；およびMossel, E.ら、Tetr
20 ahedron Asymmetry, 1997, Vol. 8, p. 1305）。例えば、増強された特性を有
するペプチド、有効な酵素インヒビター、および種々の生物学的活性を有す
る化合物の合成用のキラル構築物ブロックなどとしての利用が考えられる。
このような α 、 α -ジアルキル- α -アミノ酸は、触媒不斉合成により調製
できると考えられるが、現在のところ、その有効な調製方法は見出されてい
25 ない。

例えば、キラル相間移動触媒は、プロセス化学への適用が容易であるため、

触媒不斉合成の分野で重要性が高まっている。これまでに、主としてシコナアルカロイド誘導体を使用して、有効な相間移動触媒の設計についての多くの研究が行われ、多くの有用な方法が報告されている（例えば、Shioiri, T.ら、Stimulating Concepts in Chemistry, Vogtle, F.ら編, WILEY-VCH : Weinheim, 2000年, p.123 ; および O'Donnell, M. J., *Aldrichimica Acta*, 2001, Vol. 34, p.3参照）。しかし、このような相間移動触媒を用いる場合、ハロゲン系溶媒を使用すること、反応に長時間を要すること、低温条件が必要であることなどの種々の問題があった。上記の α 、 α -ジアルキル- α -アミノ酸の合成においても、このようなシコナアルカロイド由来のキラル相間移動触媒はあまり有用ではない。

本発明者らは、軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩を調製し、上記 α -アミノ酸を立体選択的に合成する相間移動触媒として利用できることを明らかにした（特開2001-48866号公報；特開2003-81976号公報；および Ooi, T.ら、*J. Am. Chem. Soc.*, 2000, Vol. 122, p.5228参照）。例えば、以下の式：



（ここで、 PhF_3 は3, 4, 5-トリフルオロフェニル基を表す）

で表されるスピロ型の化合物は、グリシン誘導体の不斉二重アルキル化および α -アールキル- α -アミノ酸誘導体の不斉モノアルキル化を行うために非常に有効である。しかし、このようなスピロ型触媒の調製には、多くの工程

Patent # WO 2009/054363 <http://www.googlepatent.com/login.do?&size=7&term=WO/054366+opc+noel+ambition&part=main&fromCarrie=1&getdata=1&nav=1> Page 4 of 175

Patent # WO 2009/054363 <http://www.googlepatent.com/login.do?&size=7&term=WO/054366+opc+noel+ambition&part=main&fromCarrie=1&getdata=1&nav=1> Page 4 of 175

Patent # WO 2009/054363 <http://www.googlepatent.com/login.do?&size=7&term=WO/054366+opc+noel+ambition&part=main&fromCarrie=1&getdata=1&nav=1> Page 4 of 175

Patent # WO 2009/054363 <http://www.googlepatent.com/login.do?&size=7&term=WO/054366+opc+noel+ambition&part=main&fromCarrie=1&getdata=1&nav=1> Page 4 of 175



Patent # WO 2009/054363 <http://www.googlepatent.com/login.do?&gizerForm=WC09054366opc%20searchbottompart=mainfromCarrie=1&getdata=1&nav=1> Page 4 of 175

Patent # WO 2009/054363 <http://www.googlepatent.com/login.do?&gizerForm=WC09054366opc%20searchbottompart=mainfromCarrie=1&getdata=1&nav=1> Page 4 of 175



$$R^{18}-W \quad (V)$$

(x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリー
ル部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -
ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、
 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていても

10 よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N - ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
ラルキル基；

(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、
該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

5.

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

ハロゲン原子

15

テロアラルキル基：

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N, N-

よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

5 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、

15 R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、水素原子または一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、そして

5 X^- は、ハロゲン化物アニオンであり、

式 (I V) および式 (V I) において、

R^{14} および R^{15} は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；あるいは

(ii) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、分岐していてもよい C_1

10 $\sim C_{45}$ アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；であり、ただし R^{14} および R^{15} がともに水素原子である場合を除き、

R^{15} は、

(i) 水素原子；

15 (ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -

ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、

R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていても

25 よい、アリール基、

シアノ基、

- アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
5 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
基である)、および
ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
10 ラルキル基；
(vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、該ヘテロ
アリール部分が
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、
15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-
ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、
R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていても
よい、アリール基、
20 シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
25 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

- 5 (vii)アリール基であって、該アリール基が
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-
ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、
10 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていても
よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

- 15 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

- 20 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

- 25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ $(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である)で置換されていても

5. よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基；

からなる群より選択される基であり、

R¹⁷は、分岐または環を形成していてもよいC₁~C₈アルキル基であり、式(V)および式(VI)において、

20 R^{18} は、

(i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_6 \sim C_{10}$ のアルケニル基；

25 (iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

10 ニ卜口基、

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

15 $-\text{NHCO}\text{R}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基：

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、該ヘテロ

20 アリール部分が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていても

よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラールキル基；

(vi)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていても

20 よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

10 基、カルバモイル基、N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

20 —NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

25 (ix)分岐していてもよい、C₃～C₉のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、

式 (V) において、

Wは、脱離能を有する官能基であり、そして

式 (VI) において

5 *は、新たに生成する不斉中心を示す。

好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 は、それぞれ独立して

(i) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

10 (ii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(iv) アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 $N -$ ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、
20 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である)、および
 ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
 リール基；

(v)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
 基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-
 ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、
 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていても
 よい、アリール基、

15 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

20 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

25 テロアリール基；

(vi) $-(CH_2)_n OCONR^{10}R^{11}$ (ここで、 R^{10} および R^{11} はそれぞ

れ独立して、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- (3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；
- (4) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；
- (5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリーール部分

が

- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、
10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N 、
 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここ
で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい
てもよい、アリール基、
15 シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
20 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基:

- (6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアルキル基であって、該ヘ

テロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

5 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラール基；

20 (7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

25 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい

てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

15 分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい

20 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(vii) —(CH₂)_nCONR¹²R¹³（ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基；N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N，N—ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

- 5 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基; N 、
 10 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ
 中で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい
 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

- 15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

- 20 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ
 25 る) ;

(viii) $-(CH_2)_nNR^{12}COR^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞ

れ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であつて、該アリール基が

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、

N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここ

10 で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい

てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である）、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ（ $C_1\sim C_4\text{アルキル}$ ）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ である）で置換されていてもよい、アリール基、

- 5 シアノ基、
 アミド基、
 ニトロ基、
 カルバモイル基、
 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、
 10 N 、 N -ジ（ $C_1\sim C_4\text{アルキル}$ ）カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ である）、および

- ハロゲン原子
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ
 15 テロアリール基、
 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；

- (ix) $-(CH_2)_nNR^{12}R^{13}$ （ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

- 20 (1)水素原子、
 (2)分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ 、
 (3)アリール基であって、該アリール基が
 分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ 、
 分岐していてもよい $C_1\sim C_8\text{アルコキシ基}$ 、
 25 分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ 、シアノ基、アミド基、ニ
 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、

N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

5 アミド基、

ニ卜口基、

カルバモイル基。

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

10 $-\text{NHCOR}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₆アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基；N，

20 N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

10 (x) - (CH₂)_nY-OR¹² (ここで、Yは分岐していてもよいC₁~C₄の二価の飽和炭化水素基であり、R¹²は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₈テロコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基 ; N,

20 N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,
N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、

15 シアノ基、

アミド基、

ニ卜口基、

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

20 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

25 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数であ

る) ;

(xi) - (CH₂)_n - OR¹² (ここで、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

5 (3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,

10 N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

20 キル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

25 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されている）
- 5 てもよい、アリール基、
- シアノ基、
- アミド基、
- ニトロ基、
- カルバモイル基、
- 10 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
- N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
- $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および
- ハロゲン原子
- 15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されている）もよい、ヘテロアリール基、
- からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；
- (xii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ （ここで、 R^{12} は、
- 20 (1)水素原子、
- (2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- (3)アリール基であって、該アリール基が
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基、
- 25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、

N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基; N,

20 N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

10 (xiii) - (CH₂)_n - SO - R¹² (ここで、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であつて、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

15 分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,

N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ

20 20 で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基；N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；ならびに

(xiv) $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基； N 、

N -ジ($C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ

で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい

てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

$N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

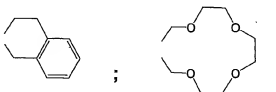
トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,
N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ
こで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、

- 5 シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
10 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル
キル基である)、および

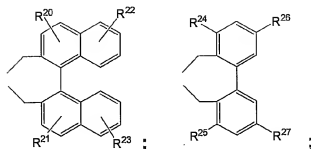
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ
15 テロアリール基、
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ
る) ;

からなる群より選択される、一価の有機基であるか、あるいは、
R⁷およびR⁸が一緒になって、- (CH₂)_m- (ここで、mは2から8の
20 整数である) ;



5



- (ここで、 R^{20} 、 R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、 R^{25} 、 R^{26} 、および R^{27} はそれぞれ独立して、
- 10 水素原子；
- 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_8$ のアルキル基；
- 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルケニル基；
- 15 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルキニル基；
- ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキル基で置換されていてもよいアリール基か、
- 20 シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール基；
- ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコシキ基か、シアノ基か、ハロゲン
- 25 原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミ

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、岐分または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール部分を有する、アラールキル基；

(C₁~C₉アルコキシ) カルボニル基:

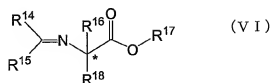
N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基；ならびに

より好適な実施態様では、上記無機塩基水溶液の濃度は、20 w/w%から70 w/w%である。

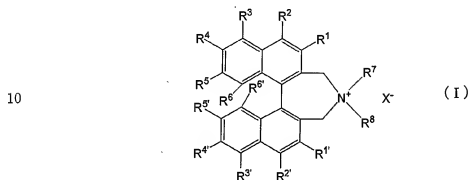
さらに好適な実施態様では、上記式 (I V) で表される化合物 1 モルに対し、上記式 (I) で表される化合物は、0.01 モル% から 5 モル% の割合で使用される。

さらにより好適な実施態様では、上記媒体と上記無機塩基水溶液との容積比は、7 : 1から1 : 5である。

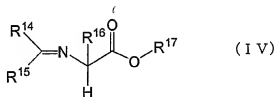
本発明はまた、式(VI)で表される化合物：



5 を立体選択的に製造するための方法を提供し、該方法は、
軸不斉に関して純粋な式 (I) :



15 で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (I V) で表される化合物:



20 を、媒体および無機塩基水溶液の存在下、式(V)の化合物:



でアルキル化する工程；を包含し、

ここで、該媒体と該無機塩基水溶液との容積比は7:1から1:5であり、
25 式(I)において、

 $R^1, R^{1'}, R^2, R^{2'}, R^3, R^{3'}, R^4, R^{4'}, R^5, R^{5'}, R^6$ および

R^9 は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子；
- (ii) アミド基；
- (iii) シアノ基；
- 5 (iv) ニトロ基；
- (v) カルバモイル基；
- (vi) $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；
- (vii) N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；
- (viii) $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
- 10 キル基である）；
- (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；
- (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；
- (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；
- (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリー
- 15 ル部分が、
 - 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 - 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 - 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
 - 基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -
 - 20 ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていても
 - よい、アリール基、
 - シアノ基、
 - アミド基、
 - 25 ニトロ基、
 - カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリアル部分が、

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、

15 R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリアル基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

テロアラルキル基；

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

15 N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ア

20 リール基；ならびに

(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、

R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁～C₄アルキル)カルバモイル基、

10 -NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

15 R⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、水素原子または一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、そして

X⁻は、ハロゲン化物アニオンであり、

式(IV)および式(VI)において、

R¹⁴およびR¹⁵は、それぞれ独立して、

20 (i)水素原子；あるいは

(ii)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基か、分岐していてもよいC₁～C₄アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；であり、ただしR¹⁴およびR¹⁵がともに水素原子である場合を除き、

25 R¹⁶は、

(i)水素原子；

- (ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基；
(iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；
(iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；
(v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が
- 5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-
ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、
10 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていても
よい、アリール基、
シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
15 カルバモイル基、
N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である) 、および
20 ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
ラルキル基；
(vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロ
アリール部分が
- 25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5' よい、アリール基、

アミド基、

カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

ハロゲン原子

(vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

25 シアノ基、

アミド基、

- ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および
ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに
10 (viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-
15 ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、
R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていても
よい、アリール基、
シアノ基、
アミド基、
20 ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
25 基である)、および
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基；

からなる群より選択される基であり、

R¹⁷は、分岐または環を形成していてもよいC₁~C₈アルキル基であり、

5 式 (V) および式 (VI) において、

 R^{18} は、

(i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基；

10 (iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルキニル基；

(v) アラルキル基であつて、該アラルキル基を構成するアリール部分が分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N、N-
ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、
R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていても
よい、アリール基。

20 シアノ基、

アミド基、

ニ卜口基、

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

25 N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

- 5 (vi)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリアル部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

- 10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基; N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリアル基、

シアノ基、

- 15 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

- 20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

- 25 (vii)アリアル基であって、該アリアル基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₆アルコキシ基

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

10 カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

-NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である）、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が³

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

20 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基；N，N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

- アミド基、
 ニトロ基、
 カルバモイル基、
 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 5 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
 基である)、および
 ハロゲン原子
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ
 10 テロアリール基；ならびに
 (ix)分岐していてもよい、C₃~C₉のプロパルギル基または置換プロパル
 ギル基；
 からなる群より選択される基であり、
 式 (V) において、
 15 Wは、脱離能を有する官能基であり、そして
 式 (VI) において
 *は、新たに生成する不斉中心を示す。
 好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物のR⁷およびR⁸は、
 それぞれ独立して
 20 (i)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で
 置換されていてもよい、C₁~C₁₂のアルキル基；
 (ii)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で
 置換されていてもよい、C₂~C₁₂のアルケニル基；
 (iii)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子
 25 で置換されていてもよい、C₂~C₁₂のアルキニル基；
 (iv)アリール基であって、該アリール基が

- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
 基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N-$
 ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、
 5 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていても
 よい、アリール基、
 シアノ基、
 アミド基、
 10 ニトロ基、
 カルバモイル基、
 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 $N,N-$ ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
 15 基である)、および
 ハロゲン原子
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
 リール基；
 (v)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
 20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
 基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N-$
 ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、
 25 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていても
 よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキルである）、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基；

(vi) $-(\text{CH}_2)_x\text{OCONR}^{10}\text{R}^{11}$ (ここで、 R^{10} および R^{11} はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

15 (2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルケニル基；

(4) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

20 分岐していてもよいC, ~C, アルキル基,

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N、N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(こ

25 で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラールキル基;

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

15 分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい

20 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁～C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

10 トロ基、カルバモイル基、N-（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、N、N-ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、または-NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

N、N-ジ（C₁～C₄アルキル）カルバモイル基、

20 -NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

25 (8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基。

シアノ基、

アミド基,

ニ卜口基、

10 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

—NHCO R^9 （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

20 (vii) - (CH₂)_nCONR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基

(3) アリール基であって、該アリール基が

25 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されている
- 5 てもよい、アリール基、
- シアノ基、
- アミド基、
- ニトロ基、
- カルバモイル基、
- 10 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
- N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
- $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および
- ハロゲン原子
- 15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されているてもよい、アリール基、ならびに
- (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基、
- 20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されている
- てもよい、アリール基、
- 25 シアノ基、
- アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(viii) - (CH₂)_nNR¹²COR¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

15 (2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

20 トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,

N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここ

15 で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

(ix) - (CH₂)_nNR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立

25 からなる群より選ばれる少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

5 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

20 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；

(x) $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$ （ここで、 Y は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

(1)水素原子、

25 (2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、
 5 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （こ
 で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい
 てもよい、アリール基、
 シアノ基、
 アミド基、
 10 ニトロ基、
 カルバモイル基、
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
 N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
 15 キル基である）、および
 ハロゲン原子
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
 リール基、ならびに
 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
 20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、
 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （こ
 25 で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい
 てもよい、アリール基、

- シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
- 5 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および
ハロゲン原子
- 10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;
(xi) - (CH₂)_n-OR¹² (ここで、R¹²は、
- 15 (1) 水素原子、
(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
(3) アリール基であって、該アリール基が
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、
- 20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
- 25 シアノ基、
アミド基、

- ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および
ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに
10 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,
15 N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、
シアノ基、
アミド基、
20 ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル
25 キル基である)、および
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

- 5 (xii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、
(1)水素原子、
(2)分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、
(3)アリール基であって、該アリール基が
分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、
10 分岐していてもよい $C_1\sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基; N 、 N -ジ($C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい
15 てもよい、アリール基、
シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
20 $N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 N 、 N -ジ($C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である)、および
ハロゲン原子
25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

5 トロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

20 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である)；

(xiii) $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
トロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基; N,
N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (こ
5 で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニ卜口基、

10 カルバモイル基

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

20 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,
N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

ニトロ基、

10

15

20

25

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,

N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ

15 で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

からなる群より選択される、一価の有機基であるか、あるいは、
5 R^7 および R^8 が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ （ここで、 m は2から8の
整数である）；



水素原子；

25 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルケニル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルキニル基；

5 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキル基で置換されていてもよいアリール基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール基；

10 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

15 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール部分を有する、アラルキル基；

20 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール部分を有する、ヘテロアラルキル基；

25 ($C_1 \sim C_3$ アルコキシ) カルボニル基；
 カルバモイル基；

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基 ; ならびに

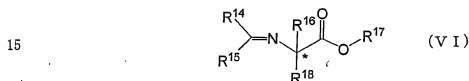
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基 (ここで、C₁~C₄アルキル基は、互いに同じでも異なってもよい) からなる群より選択される基である) からなる群より選択される二価の有機基である。

- 5 より好適な実施態様では、上記無機塩基水溶液の濃度は20w/w%から70w/w%である。

さらに好適な実施態様では、上記式 (I V) で表される化合物1モルに対し、上記式 (I) で表される化合物は、0.01モル%から5モル%の割合で使用される。

- 10 本発明はさらに、光学活性なα-アミノ酸を製造するための方法を提供し、該方法は、

上記のいずれかに記載の方法により得られた式 (V I) で表される化合物 :



(ここで、R¹⁴、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷およびR¹⁸は上記に定義した基と同様である) を酸で脱イミンする工程 ; を包含する。

- 20 本発明によれば、より安価かつ操作性のよい工程により、光学活性なアミノ酸およびその誘導体を合成する方法が提供される。

発明を実施するための最良の形態

以下、本明細書中で用いられる用語を定義する。

- 25 用語「分枝または環を形成していてもよい、C₁~C_nのアルキル基」(ここでnは整数) は、炭素数1~nの任意の直鎖アルキル基、炭素数3~nの

任意の分岐鎖アルキル基、および炭素数3～nの任意の環状アルキル基を包含する。例えば、炭素数1～6の任意の直鎖アルキル基としては、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、ペンチル、ヘキシルが挙げられ、炭素数3～6の任意の分岐鎖アルキル基としては、イソプロピル、イソブチル、tert-ブチル、イソペンチルなどが挙げられ、そして炭素数3～6の任意の環状アルキル基としては、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_1$ のアルキル基」という場合は、炭素数1～12の直鎖アルキル基、炭素数3～12の任意の分岐鎖アルキル基、および炭素数3～12の任意の環状アルキル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルキル基としては、n-ヘプチル、イソヘプチル、n-オクチル、イソオクチル、n-デシル、n-ドデシルなどが挙げられる。

なお、N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基およびN,N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイルにおいて、「 $C_1 \sim C_4$ アルキル」は、 $C_1 \sim C_4$ の直鎖アルキル基または $C_3 \sim C_4$ の分岐鎖アルキル基を意味する。

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_n$ のアルケニル基」(ここでnは整数)は、炭素数2～nの任意の直鎖アルケニル基、炭素数3～nの任意の分岐鎖アルケニル基、および炭素数3～nの任意の環状アルケニル基を包含する。例えば、炭素数2～6の任意の直鎖アルケニル基としては、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニルなどが挙げられ、炭素数3～6の任意の分岐鎖アルケニル基としては、イソプロペニル、1-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、

1-メチル-2-ブテニル、などが挙げられ、そして炭素数3~6の任意の環状アルケニル基としては、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基」という場合は、炭素数2~12の直鎖アルケニル基、炭素数3~12の任意の分岐鎖アルケニル基、および炭素数3~12の任意の環状アルケニル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルケニル基としては、1-ヘブテニル、2-ヘブテニル、1-オクテニル、1-デセニル、1-ドデセニルなどが挙げられる。

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_n$ のアルキニル基」(ここでnは整数)は、炭素数2~nの任意の直鎖アルキニル基、炭素数3~nの任意の分岐鎖アルキニル基、および炭素数3~nの任意の環状アルキニル基を包含する。例えば、炭素数2~6の任意の直鎖アルキニル基としては、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、1-ペンチニル、1-ヘキシニルなどが挙げられ、炭素数3~6の任意の分岐鎖アルキニル基としては、1-メチル-2-プロピニルなどが挙げられ、そして炭素数3~6の任意の環状アルキニル基としては、シクロプロピルエチニル、シクロブチルエチニルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基」という場合は、炭素数1~12の直鎖アルキニル基、炭素数3~12の任意の分岐鎖アルキニル基、および炭素数3~12の任意の環状アルキニル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルキニル基としては、1-ヘブチニル、1-オクチニル、1-デシニル、1-ドデシニルなどが挙げられる。

用語「分岐していてもよい $C_1 \sim C_n$ のアルコキシ基」（ここで n は整数）は、炭素数 $1 \sim n$ の任意の直鎖アルキル基を有するアルコキシ基および炭素数 $3 \sim n$ の任意の分岐鎖アルキル基を有するアルコキシ基を包含する。例えば、メチルオキシ、エチルオキシ、 n -プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、
 5 tert-ブチルオキシなどが挙げられる。

本発明において、用語「アラルキル基」の例としては、ベンジル、フェニル、およびナフチルメチルが挙げられる。

本発明における用語「ヘテロアラルキル基」の例としては、ピリジルメチル、インドリルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、およびピロリルメ
 10 チルが挙げられる。

本発明において、用語「アリール基」の例としては、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントリルなどが挙げられる。

本発明における用語「ヘテロアリール基」の例としては、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル、フリル、インドリル、チエニル、オキサゾリル、チア
 15 ゾリル、およびテトラゾリルが挙げられる。

本発明において、用語「ハロゲン原子」の例としては、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子およびフッ素原子が挙げられる。なお、本発明において、用語「ハロゲン化物アニオン」とは、ハロゲンイオンのことを意味し、塩化物イオン、臭化物イオン、ヨウ化物イオン、およびフッ化物イオンが挙げられ
 20 る。

本発明において、用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_n$ のアリル基または置換アリル基」（ここで n は整数）は、アリル基、あるいは
 1 1および/または2および/または3位に置換基を有する任意の合計炭素数
 4 4～ n の置換アリル基を意味する。例えば、2-ブテニル、1-シクロペン
 25 テニルメチル、3-メチル-2-ブテニルなどが挙げられる。

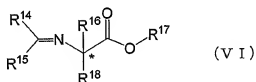
本発明において、用語「分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_n$ のプロパルギル基

または置換プロパルギル基」(ここでnは整数)は、プロパルギル基、あるいは1および/または3位に置換基を有する任意の合計炭素数4~nの置換プロパルギル基を意味する。例えば、2-ブチニル、3-トリメチルシリル-2-プロピニルなどが挙げられる。

- 5 本発明において、用語「脱離能を有する官能基」は、置換反応または脱離反応などにおいて、反応基質から離れていく原子または原子団、すなわち脱離基を意味する。例えば、ハロゲン原子、スルホニルオキシ基などが挙げられる。

以下、本発明について詳述する。

- 10 本発明の方法は、式(VI)で表される化合物：



- 15 (ここで、
R¹⁴およびR¹⁵は、それぞれ独立して、
(i)水素原子；あるいは
(ii)分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基か、分岐していてもよいC₁～C₄₅アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；であり、ただしR¹⁴およびR¹⁵がともに水素原子である場合を除き、
R¹⁶は、
(i)水素原子；
(ii)分岐または環を形成していてもよい、C₁～C₁₀のアルキル基；
25 (iii)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルケニル基；
(iv)分岐または環を形成していてもよい、C₂～C₆のアルキニル基；

- (v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
5 基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N,N -ジ
 $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、
 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていても
よい、アリール基、
シアノ基、
10 アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
 N,N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、
15 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である）、および
ハロゲン原子
からなる群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよ
い、アラルキル基；
20 (vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテ
ロアリール部分が上記群（Q）より選択される少なくとも1つの基で置換され
ていてもよい、ヘテロアラルキル基；
(vii) アリール基であって、該アリール基が上記群（Q）より選択される
少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに
25 (viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群（Q）よ
り選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール

基；

からなる群より選択される基であり、

R^{17} は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、

式 (V) および式 (VI) において、

5 R^{18} は、

(i)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

10 (iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

15 (vii)アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

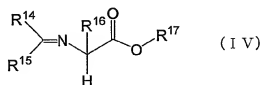
(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

(ix)分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、

25 *は、新たに生成する不斉中心を示す)を立体選択的に製造するための方法であり、この方法は、軸不性を有する光学活性な4級アンモニウム塩を相間

移動触媒として用い、式 (I V) で表される化合物：



5

(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、および R^{17} 、上記式 (V I) において定義されたものと同様である)

を、媒体および無機塩基水溶液の存在下、式 (V) の化合物：

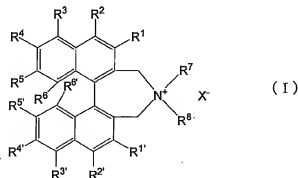


10

(ここで、 R^{18} は、上記式 (V I) において定義されたものと同様であり、そしてWは、脱離能を有する官能基である) でアルキル化する工程；を包含する。このアルキル化工程においては、該式 (I V) で表される化合物1当量に対し、該無機塩基水溶液中の無機塩基が2当量から280当量の割合で使用されるか、および/または、該媒体と該無機塩基水溶液との容積比が7：1から1：5である。

15

上記の方法において、相間移動触媒は、軸不性を有する光学活性な4級アソモニウム塩であり、代表的には、軸不斉に関して純粋な式 (I)：



25

(ここで、

R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および
 $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

5 (ii)アミド基；

(iii)シアノ基；

(iv)ニトロ基；

(v)カルバモイル基；

(vi)N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；

10 (vii)N、N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；

(viii)-NHCOR⁹ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である)；

(ix)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(x)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

15 (xi)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xii)アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリー
ル部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されてい
てもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、
20 該ヘテロアリアル部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基
で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(xiv)アリアル基であって、ここで、該アリアル基が、上記群 (Q) より
選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリアル基；なら
びに

25 (xv)ヘテロアリアル基であって、該ヘテロアリアル基が、上記群 (Q) よ
り選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル

R⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、水素原子または一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、そして

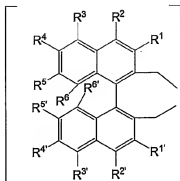
上記式(Ⅰ)の化合物は、 X^- がハロゲン化物アニオンでなる軸不斉に関して純粋な形態である。ここで、「軸不斉に関して純粋」とは、軸不斉に基づいて考えられる各種立体異性体のうち、1つの特定の異性体の存在率が、他の異性体より多いことをいう。好ましくは、当該1つの特定の異性体の存在率は、90%以上、より好ましくは95%以上、さらにより好ましくは99%以上である。

上記式 (I) で表される化合物は、(S) または (R) のいずれの立体配置を有していてもよい。

上記式（I）で表される化合物は、後述するアミノ酸またはその誘導体の製造において相關移動触媒として機能する。より具体的には、上記式（I）で表される化合物においては、当該化合物のカチオンを構成するアンモニウム部分；



が、アミノ酸またはその誘導体の製造における反応の反応性に寄与し、かつビナフチル部分：



が、該反応により得られる光学活性体（すなわち、アミノ酸またはアミノ酸誘導体）の選択性に寄与する。したがって、式（I）で表される化合物における R⁷ および R⁸ は、1 つの実施形態においては、上記カチオンのアンモニウム部分とピナフチル部分とに由来する反応性および選択性を保持し得る（あるいは、阻害しない）基である。例えば、上記アンモニウム部分およびピナフチル部分と比較して、不活性な一価の有機基または二価の有機基であり得る。言い換えれば、R⁷ および R⁸ は、それら自体（またはそれ自体が）反応性に富む基ではなく、後述するアミノ酸またはその誘導体の製造における反応に影響を及ぼさない。あるいは、上記式（I）において、R⁷ および R⁸ は、それぞれ独立して

- (i) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₁～C₁₂ のアルキル基；
- (ii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₂～C₁₂ のアルケニル基；
- (iii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₂～C₁₂ のアルキニル基；
- (iv) アリール基であって、該アリール基が上記群（Q）より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；
- (v) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群（Q）より

選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基；

(vi) $-(CH_2)_n OCONR^{10}R^{11}$ (ここで、 R^{10} および R^{11} はそれぞれ独立して、

- 5 (1)水素原子、
(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
(3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；
(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；
(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリアル部分
10 が上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、
アラルキル基；

(6)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリアル部分が、上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

- 15 (7)アリアル基であって、該アリアル基が上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリアル基、ならびに

(8)ヘテロアリアル基であって、該ヘテロアリアル基が上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基、

- 20 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である)；

(vii) $-(CH_2)_n CONR^{12}R^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

- (1)水素原子、
25 (2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
(3)アリアル基であって、該アリアル基が上記群(Q)より選択され

る少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群 (Q)

より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

5) からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) :

(viii) - (CH₂)_nNR¹²COR¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

10 (2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択され

る少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群 (Q)

より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリー
ル基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) :

(ix) - (CH₂)_nNR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

20 (1)水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択され

る少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群 (Q)

25 より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリー
ル基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(x) $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$ (ここで、 Y は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

- 5 (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに
- (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、
- 10 からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xi) $-(CH_2)_n -OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

- 15 (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに
- (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、
- 20 からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xii) $-(CH_2)_n -S-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

- 25 (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基。

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) :

(xiii) — (CH₂)_n — SO — R¹² (ここで、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xiv) $-(\text{CH}_2)_n-\text{SO}_2-\text{R}^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が上記群(Q)より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

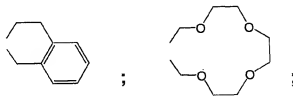
からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数であ

る) ;

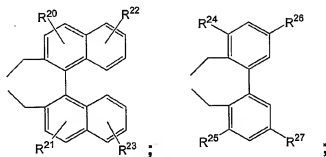
からなる群より選択される、一価の有機基であるか、あるいは、

R⁷およびR⁸が一緒になって、- (CH₂)_m- (ここで、mは2から8の整数である) ;

5

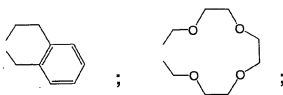


10

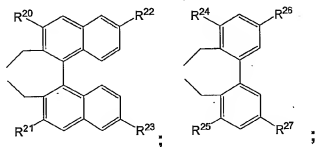


15

より具体的な例としては、



20



25

(ここで、 R^{20} 、 R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、 R^{25} 、 R^{26} 、および R^{27} はそれぞれ独立して、

水素原子；

5 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_8$ のアルキル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルケニル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルキニル基；

10 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキル基で置換されていてもよいアリール基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは C_2
15 $\sim C_8$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール基；

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミ
20 ノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_8$ を有する環状アミ
25 ノ基か、で置換されていてもよい、アリール部分を有する、アラルキル基；

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原

子で置換されていてもよいC₁～C₃アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよいC₁～C₈アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいはC₂～C₈を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリアル部分を有する、ヘテロアラルキル基；

(C₁~C₃アルコキシ)カルボニル基；

カルバモイル基；

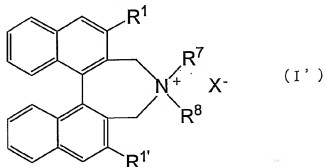
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; ならびに

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基(ここで、C₁~C₄アルキル基は、互いに同じでも異なってもよい)からなる群より選択される基である)からなる群より選択される二価の有機基である。

本発明においては、上記式(1)において、 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、好ましくは、それぞれ独立して、

水素原子；ならびに

アリール基であつて、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；からなる群より選択され、より好ましくは、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される。特に、上記式 (I) で表される化合物のうち、以下の式 (I') :



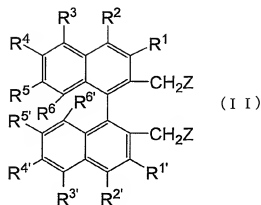
5

10



20

25

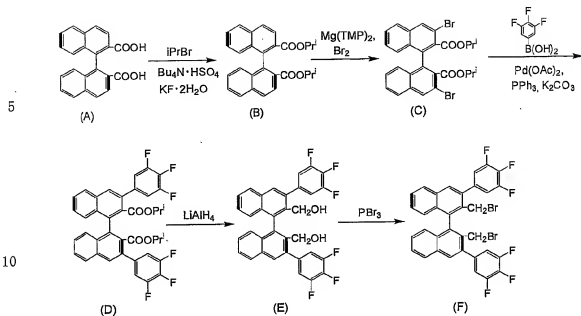


(ここで、 R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および $R^{6'}$ は、上記式 (I) において定義されたものと同様であり、そして Z はハロゲン原子である) で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、以下の式 (I I I) :



(ここで、 R^7 および R^8 は、上記式 (I) において定義されたものと同様である) で表される 2 級アミンと反応させることによって製造することができる。

上記式 (I I) の化合物は、例えば、容易に入手可能な 1, 1' - ビナフチル-2, 2' - ジカルボン酸 (例えば、Seki, M.ら、Synthesis, 2000年, p. 1677を参照) から、以下のスキームに示すような公知の工程を経て容易に調製され得る (例えば、Ooi, T.ら、J. Org. Chem., 2003年, 68巻, p. 4577を参照)。1, 1' - ビナフチル-2, 2' - ジカルボン酸は、(S) 体または (R) 体のいずれをも用いることができ、必要に応じて当業者によって任意に選択され得る。



式 (I I) で表される化合物の製造方法を、上記スキームに示すようなジ
 プロミド (F) を得る場合を例に挙げて、具体的に説明する：まず、ジカル
 15 ボン酸 (A) を、臭化イソプロピル、触媒 $\text{Bu}_4\text{N} \cdot \text{HSO}_4$ 、および $\text{KF} \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ を用いて、対応するジイソプロピルエステル (B) に変換する。得
 られた化合物 (B) を、ビス (2, 2, 6, 6-テトラメチルピペラミド)
 マグネシウム (以下、 $\text{Mg}(\text{TMP})_2$ という) で処理し、続いて Br_2 を添
 20 加して、3, 3'-ジブromo-1, 1'-ジナフチル-2, 2'-ジカルボ
 ン酸エステル (C) を得る。次いで、酢酸パラジウム、トリフェニルホスフ
 イン、および炭酸カリウムの存在下で、得られた化合物 (C) と 3, 4, 5
 -トリフルオロフェニルボロン酸との Suzuki-Miyaura の交差
 カップリング反応を行って、3, 3'-ビス (3, 4, 5-トリフルオロフ
 25 エニル) -1, 1'-ビナフチル-2, 2'-ジカルボン酸エステル (D)
 を得る。さらに、この化合物 (D) を LiAlH_4 で還元し、次いで得られ

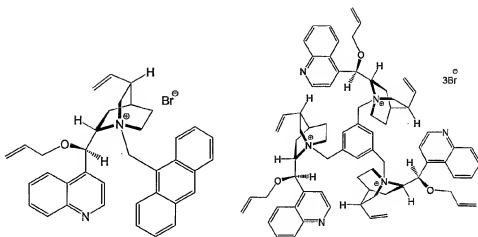
た粗アルコール（E）をPBr₃で処理することにより、上記式（I I）に相当するジプロミド（F）を得ることができる。

一方、上記式（I I I）の2級アミンは、市販されているものが多く、入手が容易であるため、適宜選択することができる。

- 5 上記式（I）の化合物の製造のための反応に用いられる有機溶媒としては、ニトリル系溶媒（例えば、アセトニトリル、プロピオニトリルなど）、エーテル系溶媒（例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、イソプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、2-メトキシエチルエーテルなど）、アルコール系溶媒（例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、tert-ブタノールなど）
10 などが挙げられる。特に、アセトニトリルが好ましい。酸捕捉剤としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基が挙げられる。

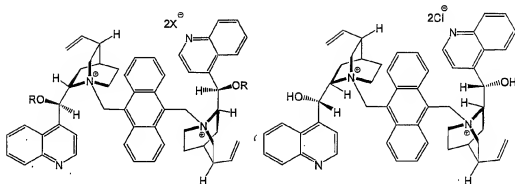
- 上記反応において、式（I I I）の2級アミンは、式（I I）の化合物に
15 対して好ましくは1～4当量、より好ましくは2～3当量用いられる。酸捕捉剤は、式（I I）の化合物に対して好ましくは1～4当量、より好ましくは約1～2当量用いられる。式（I I）の化合物と式（I I I）の2級アミンとは、酸捕捉剤の存在下で、適切な有機溶媒中、攪拌しながら反応させる。反応温度は、好ましくは、室温から有機溶媒の沸点までであり、より好ましくは加熱還流下で反応が行われる。反応時間は、好ましくは30分間～24
20 時間、より好ましくは6時間～12時間である。このとき、有機溶媒は、式（I I）の化合物に対して容積（mL）／重量（g）比で、好ましくは5～50倍、より好ましくは5～30倍の量を用いる。反応終了後、反応混合物を、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素などによる抽出、シリカ
25 ゲルカラムクロマトグラフィーなどによって単離・精製することにより、式（I）で表される化合物を得ることができる。なお、上記単離・精製は必須

5



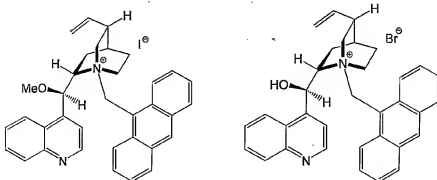
10

15

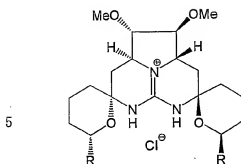


R=H またはアリル, X=Cl または Br

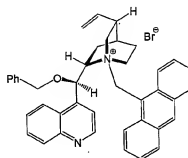
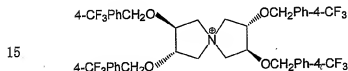
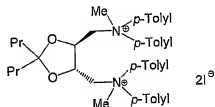
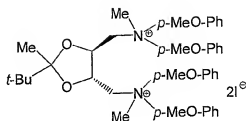
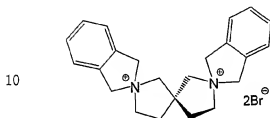
20



25



R=Me または H



が挙げられる。

上記アルキル化工程で用いられる媒体としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルエーテル、イソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどが挙げられ、水と混ざらない媒体が好ましい。媒体は、式 (I V) の化合物に対して容積 (mL) / 重量 (g) 比で好ましくは 5 ~ 30 倍、より好ましくは 8 ~ 25 倍を使用し得る。

上記アルキル化工程で用いられる無機塩基水溶液としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化ルビジウム、水酸化セシウムなどが挙げられる。無機塩基水溶液中の無機塩基は、

式(IV)の化合物に対して2~280当量、好ましくは14~56当量を
使用し得る。無機塩基水溶液は、20~70w/w%、好ましくは30~6
0w/w%を使用し得る。

媒体と無機塩基水溶液との容積比は、媒体容積 (mL) / 無機塩基水溶液容積 (mL) 比で $7/1 \sim 1/5$ 、好ましくは $4/1 \sim 1/1$ である。

上記アルキル化工程において、式 (V) の化合物は、式 (IV) の化合物に対して、好ましくは 1~1.5 当量、より好ましくは 1.1~1.3 当量、さらにより好ましくは 1.2~1.25 当量用いる。相間移動触媒 (代表的には、式 (I) の化合物) は、式 (IV) の化合物に対して、好ましくは 0.01~5 モル%、より好ましくは 0.05~2 モル% を用いる。アルキル化工程は、-30℃ から室温までの間の適切な温度、好ましくは -20℃ ~ 0℃ で、空气中、好ましくはアルゴン雰囲気下にて行われる。この工程は、アルキル化反応が十分に進行するまで適切な時間にわたって、攪拌しながら行われ得る。反応時間は、好ましくは 30 分~48 時間、より好ましくは 1 時間~24 時間である。

本発明の方法によれば、光学活性な式(VI)の化合物を、高収率かつ高光学純度で得ることができる。ここで、高光学純度とは、好ましくは85% ee以上、より好ましくは90% ee以上、さらに好ましくは95% ee以上の光学純度であることをいう。

本発明の別の局面では、本発明は、光学活性な α -アミノ酸の製造方法を提供し、この方法は、上記の方法により得られた光学活性な式(VI)の化合物を、酸で脱イミンする工程を包含する。この脱イミン工程において用いられる酸は、無機酸、または2塩基酸以上の有機酸が好ましい。この工程は、具体的には、適切な媒体(例えば、テトラヒドロフラン、トルエン)中の式(VI)の化合物を酸(例えば、塩酸、クエン酸)の水溶液で室温にて処理することにより、二重結合を介して窒素原子に連結している部分が脱離して、

5 实施例

10 A) の合成>

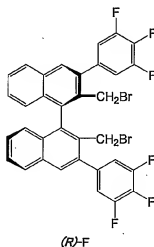
15



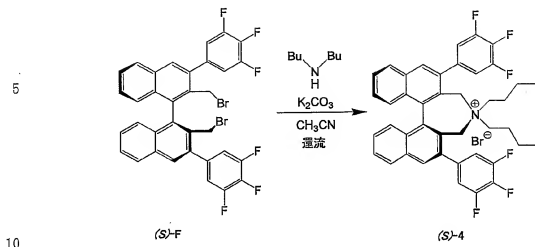
得た。この化合物Bに、テトラヒドロフラン中新たに調製した4当量のMg
(TMP)₂を0℃で滴下し、続いて-78℃で8当量の臭素を滴下し、そ
の後、室温で1時間撹拌して、化合物Cを91%の収率で得た。化合物Cを
ジメチルホルムアミドに溶解し、さらにジメチルホルムアミド中5mol%
5 の酢酸パラジウム、15mol%のPPH₃、および3当量の炭酸カリウム
の存在下で、2.4当量の3,4,5-トリフルオロフェニルボロン酸を加
えて、Suzuki-Miyauraの交差カップリング反応を90℃にて
8時間行つて、化合物Dを94%の収率で得た。次いで、化合物Dを、0℃
~室温にてテトラヒドロフラン中3当量のLiAlH₄で還元して化合物E
10 を得た。得られた化合物Eを、テトラヒドロフラン中0.5当量のPBr₃
と0℃にて1時間撹拌して、S体の化合物(S)-Fを90%の収率で得た。

<参考例2：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質(化合物(R)-
A)の合成>

15 化合物(S)-Aの代わりに、化合物(R)-A((R)-1,1'-ビ
ナフチル-2,2'-ジカルボン酸)を用いたこと以外は、上記参考例1と
同様にして、以下の式で表されるR体の化合物(R)-Fを良好な収率で得
た。



<参考例 3 : 4 級アンモニウム塩 (化合物 (S) - 4) の合成>



上記参考例 1 で得られた化合物 (S) - F (S 体) (280 mg, 0.4 mmol)、ジブチルアミン (140 μ L, 0.8 mmol)、および炭酸カリウム (8.2 mg, 0.6 mmol) をアセトニトリル (5 mL) に加え、

15 攪拌しながら 10 時間加熱還流した。得られた混合物を水中に注ぎ、ジクロロメタンを加えて攪拌した。有機層を回収し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして濃縮した。残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: メタノール/ジクロロメタン=1:20) に付して精製し、化合物 (S) - 4 (S 体) (247 mg, 0.33 mmol) を 83% の収率で得た。

20 得られた化合物 (S) - 4 (S 体) の NMR スペクトルは以下のとおりであった:

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 7.97-7.95 (4H, m, Ar-H), 7.55-7.51 (2H, m, Ar-H), 7.27-7.23 (8H, m, Ar-H), 4.99 (2H, d, $J=14.2$ Hz, Ar- CH_2), 3.74 (2H, d, $J=13.9$ Hz, Ar- CH_2), 3.32 (2H, t, $J=12.5$ Hz, N- CH_2 - CH_2), 2.56

25

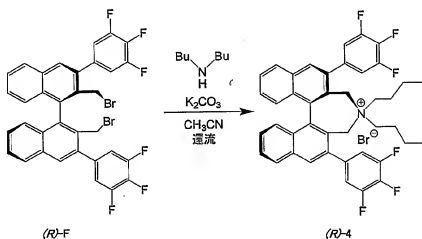
(2H, t, $J=12.3\text{ Hz}$, $\text{N-CH}_2\text{-CH}_2$), 1.06–0.97 (6H, m, CH_2), 0.71 (6H, t, $J=6.9\text{ Hz}$, CH_3), 0.23 (2H, bs, CH_2); $^{13}\text{C-NMR}$ (100MHz, CDCl_3) δ 150.95 (d, $J_{\text{C-F}}=253\text{ Hz}$), 139.61 (ddd, $J_{\text{C-F}}=253, 15, 15\text{ Hz}$), 138.31, 136.86, 134.64 (d, $J_{\text{C-F}}=4\text{ Hz}$), 133.44, 131.13, 130.85, 128.31, 128.28, 127.66, 127.37, 123.34, 115.31–113.76 (m), 57.58, 57.37, 24.60, 19.32, 13.24.

10

<参考例4：4級アンモニウム塩（化合物（R）-4）の合成>

15

20



25

化合物（S）-Fの代わりに、上記参考例2で得られた化合物（R）-F（R体）（280mg, 0.4mmol）を用いたこと以外は、上記参考例3と同様にして、R体の化合物（R）-4を良好な収率で得た。

5



(土) アーラニンエチルエステル(化合物1)の塩酸塩(10.7g; 69.6mmol)をエタノール(70mL)に加え、さらにトリエチルアミン(7.04g; 69.6mmol)を加えて攪拌した。60℃の湯浴で融解したp-クロロベンズアルデヒド(化合物2)(9.78g; 69.6mmol)を加え、室温で攪拌し、水を加えて抽出した。

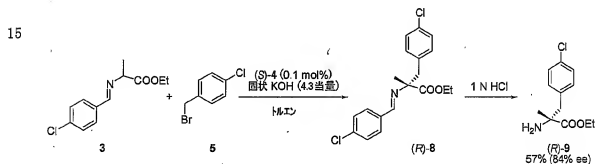
mol) をエタノール (24 mL) に溶解させ、室温まで放冷し、これを化合物 1 のエタノール溶液に滴下した。室温で 2 時間撹拌した後、エタノールを減圧留去した。そこに半飽和の食塩水 (20 mL) を加え、酢酸エチル (80 mL × 1) で抽出した。酢酸エチル層を、飽和食塩水 (10 mL) で洗淨し、硫酸ナトリウムを敷いたろ紙にてろ過した。ろ液を減圧濃縮して、アラニンエチルエステル-p-クロロベンジルシッフ塩基 (化合物 3) (15.9 g; 収率 95%) を得た。

次いで、化合物 3 (1.20 g; 5 mmol)、化合物 5 (1.23 g; 6 mmol)、および相間移動触媒 (S) - 4 (3.7 mg; 5 μmol) をトルエン (20 mL) に加え、氷・塩冷却下で激しく撹拌した (1000 ~ 1400 rpm)。内温が -5℃ 以下になったところで、水酸化セシウム 1 水和物 (4.20 g; 25 mmol) を加えた。ここで、水酸化セシウム 1 水和物は、潮解性が著しいため、すばやく秤量して一気に加えた。内温を -5℃ ~ -12℃ に保ちながら 3.5 時間撹拌した。反応の終了は、TLC 上で化合物 3 が分解して生じる化合物 1 の消失で確認した。なお、TLC は、展開溶媒としてヘキサン：酢酸エチル：トリエチルアミン = 5 : 5 : 0.1 を用い、化合物 1 の R_f 値は約 0.1 であり、そして化合物 1 はニンヒドリン発色により赤色を呈した。反応終了後、反応混合物に蒸留水 (5 mL) を加えて、トルエン層を回収した。さらにトルエン (5 mL × 2) で抽出し、これを回収したトルエン層と合わせた。トルエン層には、アルキル化されたシッフ塩基 (化合物 (R) - 8) が含まれる。

得られたトルエン層に 1 N の塩酸 (10 mL) を加え、3 時間室温で撹拌した。反応の終了は、TLC 上で化合物 8 が分解して生じる (R) - α-メチル-4-クロロフェニルアラニンエチルエステル (化合物 (R) - 9) のトルエン層における消失により確認した。TLC は、上記と同様の展開溶媒を用い、化合物 9 の R_f 値は約 0.3 であり、UV 254 nm 照射により確

認でき、さらにニンヒドリン発色で黄褐色を呈した。反応終了後、水層を回収し、トルエン（10 mL）で洗浄した後、発泡に気をつけながら pH 11 以上（ユニバーサル pH 試験紙で確認した）になるまで炭酸ナトリウムを加えた。次いで、酢酸エチル（15 mL × 2）で抽出し、酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して、化合物（R）-9（0.66 g；収率 55%、光学純度 90% ee）を得た。得られた化合物（R）-9 の光学純度は、HPLC にて分析した [カラム：CHIRALCEL AD（4.6 mm φ × 25 cm）；溶離液：ヘキサン／イソプロパノール／ジエチルアミン = 99/1/0.1、0.5 mL/分；温度：室温；検出：UV 267, 5 nm；保持時間：（S）体 = 24.7 分、（R）体 = 26.3 分]。

＜比較例 2：固状水酸化カリウムを用いるアラニンエチルエステルのアルキル化反応＞



20 上記比較例 1 において、水酸化セシウム 1 水和物の代わりに、水酸化カリウム（固体 1.40 g ; 21.3 mmol）を用いて、内温を $-5^{\circ}\text{C} \sim -10^{\circ}\text{C}$ に保ちながら 2 時間攪拌したこと以外は、上記比較例 1 と同様に操作を行った。その結果、化合物 (R) - 9 を、0.69 g（収率 57%、光学純度 84% ee）得ることができた。

5



25

(160 mL×1)で抽出した。酢酸エチル層を、飽和食塩水(20 mL)で洗浄し、硫酸ナトリウムを敷いたろ紙にてろ過した。ろ液を減圧濃縮して、L-アラニンエチルエステル-p-クロロベンジルシッフ塩基(化合物L-3)(36.75 g; 収率102%)を得た。

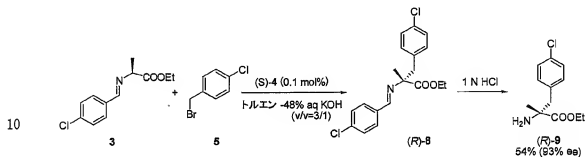
- 5 次いで、化合物L-3(5.99 g; 25 mmol)、化合物5(7.19 g; 35 mmol)、および相間移動触媒(R)-4(18.7 mg; 25 μ mol)をトルエン(100 mL)に加え、氷・塩冷却下で激しく撹拌した(1400 rpm)。内温が-5℃以下になったところで、-20℃の冷凍庫で一晩冷却した48%水酸化カリウム水溶液(45 g; 386 mmol)を加えた。内温を-5℃~-10℃に保ちながら3.5時間撹拌した。
- 10 反応の終了は、上記比較例1と同様にTLC上で化合物L-3が分解して生じる化合物L-1の消失で確認した。反応終了後、トルエン層を回収し、さらにトルエン(25 mL×4)で抽出し、これを回収したトルエン層と合わせた。トルエン層には、アルキル化されたシッフ塩基(化合物8)が含まれる。
- 15

- 得られたトルエン層に1Nの塩酸(100 mL)を加え、3.5時間室温で撹拌した。反応の終了は、上記比較例1と同様に、TLC上で化合物8が分解して生じる(S)- α -メチル-4-クロロフェニルアラニンエチルエステル(化合物(S)-9)のトルエン層における消失により確認した。
- 20 反応終了後、水層を回収し、トルエン(30 mL)で洗浄し、発泡に気をつけながらpH11以上(ユニバーサルpH試験紙で確認した)になるまで炭酸ナトリウムを加えた。次いで、酢酸エチル(75 mL×2)で抽出し、酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して、化合物(S)-9(3.81 g; 収率63%、光学純度93% ee)を得た。

- 25 このように、48%水酸化カリウム水溶液を塩基として用いたアルキル化反応により、水酸化セシウム1水和物を塩基として用いた場合(比較例1)

と同様の反応速度で進行し、同程度の立体選択性で生成物が得られることが確認できた。

<実施例 2 : 48 %水酸化カリウム水溶液を用いるアラニンエステルのアルキル化反応>

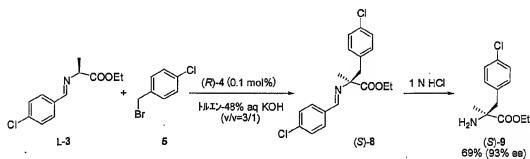


15 上記比較例 1 で調製した化合物 3 (1.20 g ; 5 mmol)、化合物 5 (1.23 g ; 6 mmol)、および相間移動触媒 (S)-4 (3.7 mg ; 5 μmol) をトルエン (20 ml) に加え、氷・塩冷却下で激しく撹拌した (1400 rpm)。内温が -5℃ 以下となったところで、48 %水酸化カリウム水溶液 (8.88 g ; 76 mmol) を加えた。内温を -5℃ ~ -10℃ に保持しながら、3.5 時間撹拌した。反応の終了を、上記比較例 1 と同様の、TLC 上での化合物 3 の分解により生じる化合物 1 の消失に
20 によって確認した。反応終了後、トルエン層を回収し、さらにトルエン (10 mL × 2) で抽出し、これを回収したトルエン層と合わせた。トルエン層には、アルキル化されたシッフ塩基 (化合物 (R)-8) が含まれていることを確認した。

25 得られたトルエン層に 1 N の塩酸 (15 mL) を加え、3 時間室温で撹拌した。反応の終了を、上記比較例 1 と同様の、TLC 上での化合物 (R)-8 の分解により生じる (R)-α-メチル-4-クロロフェニルアラニンエ

チルエステル（化合物（R）-9）がトルエン層中で消失したことによって確認した。反応終了後、水層を回収し、トルエン（10 mL）で洗浄し、発泡に留意しながら、pH 11以上（ユニバーサルpH試験紙で確認）になるまで炭酸ナトリウムを加えた。次いで、酢酸エチル（15 mL×2）で抽出し、酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して化合物（R）-9（0.65 g；収率54%、光学純度93% ee）を得た。

＜実施例3：48%水酸化カリウム水溶液を用いるアラニンエチルエステルのアルキル化反応のスケールアップ実験＞



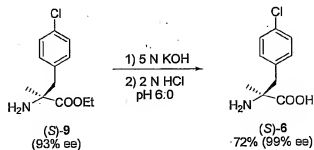
上記実施例1に記載のように調製した化合物L-3（17.6 g；73.5 mmol）、化合物5（21.1 g；102.9 mmol）、および相間移動触媒（R）-4（55 mg；73.5 μmol）をトルエン（294 mL）に加え、氷・塩冷却下で、激しく攪拌した（1400 rpm）。内温が-3℃になったところで、-20℃の冷凍庫で一晩冷却した48%水酸化カリウム水溶液（134 g；1.15 mol）を加えた。内温を-1～-5℃に保ちながら2.5時間攪拌した。反応の終了は、上記比較例1と同様にTLCにより確認した。反応終了後、トルエン層を回収し、残った水層に蒸留水（80 mL）を加え、さらにトルエン（80 mL×3）で抽出し、これを回収したトルエン層と合わせた。トルエン層には、アルキル化されたシッフ

塩基（化合物（S）－8）が含まれる。

得られたトルエン層に1Nの塩酸（240 mL）を加え、3.75時間室温で撹拌した。反応の終了は、上記比較例1と同様に、TLCで確認した。反応終了後、水層を回収し、トルエン（90 mL）水層を洗浄し、発泡に気をつけながらpH11以上（ユニバーサルpH試験紙で確認した）になるまで炭酸ナトリウムを加えた。次いで、酢酸エチル（200 mL×1、150 mL×1）で抽出し、酢酸エチル層を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して、化合物（S）－9（12.3 g；収率69%、光学純度93% ee）を得た。

48%水酸化カリウム水溶液を塩基として用いた化合物8へのアルキル化反応（実施例3）は、水酸化セシウム1水和物を塩基として用いたアルキル化反応（比較例1）と比べて、立体選択性において、同程度のパフォーマンスを示し、収率においては、55%から69%へと大幅に向上した。また、データは示していないが、アルキル化のためのシッフ塩基である化合物3は、ラセミ体もL-体も同様の反応速度および立体選択性を示した。このことから、化合物3は、ラセミ体でもL-体でも使用できることが確認された。

<実施例4：エチルエステル体の加水分解>



上記実施例1で得られた化合物（S）－9（2.15 g；8.88 mmol）

1) と上記実施例 3 で得られた化合物 (S) - 9 (10.7 g; 44.4 mmol) とを合わせ、5 N の水酸化カリウム水溶液 (30 mL) を加え、40 ~ 50 °C の湯浴中で溶液が均一になるまで 1 時間攪拌した。室温まで放冷した後、2 N の塩酸を pH 6.0 になるまで加えた。白色の沈殿が生じたことを確認した後、溶液を氷冷下で 30 分間攪拌した。白色の沈殿をろ取し、エタノール (20 mL) で洗浄した。結晶を 50 °C で一晚乾燥させ、(S) - α -メチル-2-フルオロフェニルアラニン (化合物 (S) - 6) (8.17 g; 収率 72%、光学純度 99% ee) を得た。得られた化合物 (S) - 6 の光学純度は、HPLC にて分析した [カラム: SUMICHIRAL OA-5000 (4.6 mm ϕ \times 15 cm); 溶離液: メタノール/2 mM 硫酸銅 (II) 水溶液 = 30/70、1.0 mL/分; 温度: 37 °C; 検出: UV 254 nm; 保持時間: (S) 体 = 40.4 分、(R) 体 = 57.2 分]。化合物 L-1 の塩酸塩から化合物 (S) - 6 までの 4 工程の通算収率は、50% であった。

15

産業上の利用可能性

本発明によれば、より安価かつ操作性のよい工程により、光学活性なアミノ酸およびその誘導体を合成する方法が提供される。特に、 α -アルキル- α -アミノ酸誘導体および α 、 α -ジアルキル- α -アミノ酸誘導体の合成に非常に有用である。このようにして合成されるアミノ酸誘導体は、増強された特性を有するペプチドの設計において、および有効な酵素インヒビターとして、ならびに種々の生物学的活性を有する化合物の合成用のキラル構築物ブロックとして、特別な役割を果たす。したがって、新規な食品や医薬品の開発・製造に有用である。

25

ここで、該式 (I V) で表される化合物 1 当量に対し、該無機塩基水溶液中の無機塩基が 2 当量から 280 当量の割合で使用され、

式 (I) において、

R^1 、 $R^{1'}$ 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 R^3 、 $R^{3'}$ 、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 および
5 $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) アミド基；

(iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

10 (v) カルバモイル基；

(vi) $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基；

(vii) N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基；

(viii) $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル基である})$ ；

15 (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリー
ル部分が、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル基}$ 、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5 \text{ アルコキシ基}$ 、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル基}$ 、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -
ジ ($C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、

25 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル基である})$ で置換されていても
よい、アリール基、

- シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
- 5 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である)、および
 ハロゲン原子
- 10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
ラルキル基；
 (xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、
該ヘテロアリール部分が、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- 15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-
ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、
 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていても
- 20 よい、アリール基、
 シアノ基、
 アミド基、
 ニトロ基、
 カルバモイル基、
- 25 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、
 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

5 テロアララルキル基:

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

10 基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基。

シアノ基、

15 アミド基、

ニ卜口基、

カルパモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

20 $-\text{NHCOR}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

25 (xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基

分岐していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N, N -ジ($C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

10 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して、水素原子または一価の有機基であるか、

20 あるいは一緒になって二価の有機基を表し、そして

X^- は、ハロゲン化物アニオンであり、

式 (IV) および式 (VI) において、

R^{14} および R^{15} は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；あるいは

25 (ii) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、分岐していてもよい $C_1 \sim C_{4.5}$ アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、ア

リール基；であり、ただし R^{14} および R^{15} がともに水素原子である場合を除き、

R^{16} は、

(i) 水素原子；

5 (ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -
ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、
 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていても

15 よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル
基である）、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
ラルキル基；

(vi)ヘテロアリアル部分を有するヘテロラルキル基であって、該ヘテロアリアル部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリアル基、

10 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

15 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

20 テロラルキル基；

(vii)アリアル基であって、該アリアル基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

25 基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、

R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

10 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、

20 R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

からなる群より選択される基であり、

R¹⁷は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、式 (V) および式 (VI) において、

10 R¹⁸は、

(i)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基;

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基;

(iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基;

15 (iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基;

(v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

20 基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

5 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

(vi)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロ

10 アリアル部分が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

15 基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

25 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアルキル基；

(vii)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていても

10 よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-

ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

15 (ix) 分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、

式 (V) において、

W は、脱離能を有する官能基であり、そして

20 式 (VI) において

* は、新たに生成する不斉中心を示す、方法。

2. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 が、それぞれ独立して

(i) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で
25 置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

(ii) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で

置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_9 \sim C_{19}$ のアルキニル基；

(iv) アリール基であって、該アリール基が

5 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹（ここで、

10 R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基

ニ卜口基、

15 カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキルである)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基：

(v) ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

25 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

- 基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
- 5 シアノ基、
 アミド基、
 ニトロ基、
 カルバモイル基、
 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 10 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および
 ハロゲン原子
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ
 15 テロアリール基；
 (vi) - (CH₂)_n OCONR¹⁰R¹¹ (ここで、R¹⁰およびR¹¹はそれぞれ独立して、
 (1) 水素原子、
 (2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
 20 (3) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルケニル基；
 (4) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルキニル基；
 (5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が
 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
 25 分岐していてもよいC₁~C₆アルコキシ基、
 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ である)で置換されているともよい、アリール基、

5 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、

10 N 、 N -ジ($C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されているともよい、アリール基；

15 (6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラール基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ 、

分岐していてもよい $C_1\sim C_8\text{アルコキシ基}$ 、

20 分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ 、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、 N 、 N -ジ($C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4\text{アルキル基}$ である)で置換されているともよい、アリール基、

25 シアノ基、

アミド基、

ニ卜口基、

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N、N'-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

5 $-\text{NHCO}\text{R}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

10 (7)アリール基であつて、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

15 トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,
N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

20 ニ卜口基

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 $-\text{NHCOR}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

5 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基; N,
N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されてい

10 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) :

(vii) - (CH₂)_nCONR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

15 N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

20 リール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

25 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基； N 、

N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ

で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ;

(viii) $-(CH_2)_n NR^{12} COR^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基 ; $N,$

25 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい

てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

15 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,

N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい

20 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

- 5 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
 トロ基、カルバモイル基、N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基;N,
 10 N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ
 で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい
 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

- 15 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

- 20 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアリール基、

- 25 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ
 る) ;

(x)- $(CH_2)_nY-OR^{12}$ (ここで、Yは分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$

の二価の飽和炭化水素基であり、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基； N 、

N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ

10 で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい

てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

5 シアノ基、

ニトロ基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

ハロゲン原子

15 テロアリール基.

(xi) — (CH₂)_n — OR¹² (ここで、R¹²は、

20 (2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

25 トロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基; N,
N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここ

で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

10 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; N ,

N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ

20 で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xii) - (CH₂)_n - S - R¹² (ここで、R¹²は、

10 (1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

25 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

- 5 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
 トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基; N 、
 10 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ
 で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されてい
 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

- 15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

- 20 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数であ
 25 る);

(xiii) $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

- (1) 水素原子、
(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
(3) アリール基であって、該アリール基が
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基； N 、
 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （こ
で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい
10 てもよい、アリール基、
シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、
 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である）、および
ハロゲン原子
20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基、ならびに
(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、
25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基； N 、

N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である) ; ならびに

(xiv) $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基; N,

25 N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ 。(ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されてい

てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

15 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい

20 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁～C₄アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

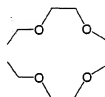
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

からなる群より選択される、一価の有機基であるか、あるいは、

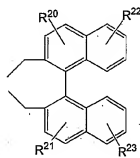
R⁷およびR⁸が一緒になって、—(CH₂)_m—（ここで、mは2から8の整数である）；



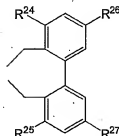
；



；



；



；

（ここで、R²⁰、R²¹、R²²、R²³、R²⁴、R²⁵、R²⁶、およびR²⁷はそれぞれ独立して、

水素原子；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₁～C₈のアルキル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルキニル基；

10

15

20

25

(C₁~C₈アルコキシ) カルボニル基；

カルバモイル基；

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基;ならびに

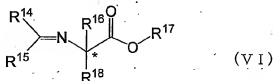
N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基(ここで、C₁~C₄アルキル基は、互いに同じでも異なってもよい)からなる群より選択される基である)からなる群より選択される二価の有機基である、請求項1に記載の方法。

3. 前記無機塩基水溶液の濃度が20w/w%から70w/w%である、請求項1または2に記載の方法。

4. 前記式(IV)で表される化合物1モルに対し、前記式(I)で表される化合物が、0.01モル%から5モル%の割合で使用される、請求項1から3のいずれかに記載の方法。

5. 前記媒体と前記無機塩基水溶液との容積比が、7 : 1から1 : 5である、請求項1から4のいずれかに記載の方法。

6. 式 (VI) で表される化合物:

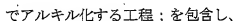


を立体選択的に製造するための方法であって、

25 軸不斉に関して純粋な式 (I) :


$$\begin{array}{c} \text{R}^{14} \\ \diagup \\ \text{C}=\text{N} \\ \diagdown \\ \text{R}^{15} \end{array} \begin{array}{c} \text{R}^{16} \\ | \\ \text{C} \\ | \\ \text{H} \end{array} \begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{C} \\ | \\ \text{O}-\text{R}^{17} \end{array} \quad (\text{IV})$$

15



ここで、該媒体と該無機塩基水溶液との容積比が7:1から1:5であり、

式 (I) において、

 $R^1, R^{1'}, R^2, R^{2'}, R^3, R^{3'}, R^4, R^{4'}, R^5, R^{5'}, R^6$ および

R^6 は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) アミド基；

(iii) シアノ基：

(iv) 二卜口基；

(v) カルパモイル基：

(vi) N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基;

(viii) -NHCO-R^9 (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である) :

5 (x)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリー部分が、

10 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

15 よい、アリール基、

アミド基、

カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリアル部分が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

5 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹（ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

アミド基、

ニ卜口基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

15 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCO-R⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

20. テロアラルキル基；

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
25 基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-
ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹（ここで、

R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

10 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、

20 R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

- 5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

からなる群より選択される基であり、

R⁷およびR⁸はそれぞれ独立して、水素原子または一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、そして

- 10 X⁻は、ハロゲン化物アニオンであり、
式 (I V) および式 (V I) において、
R¹⁴およびR¹⁵は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子; あるいは

- (ii) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基か、分岐していてもよいC₁~C₄アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基; であり、ただしR¹⁴およびR¹⁵がともに水素原子である場合を除き、

R¹⁶は、

(i) 水素原子;

- 20 (ii) 分岐または環を形成していてもよい、C₁~C₁₀のアルキル基;
(iii) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルケニル基;
(iv) 分岐または環を形成していてもよい、C₂~C₆のアルキニル基;
(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

- 25 分岐していてもよいC₁~C₆アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

10 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

15 ラルキル基;

(vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロアララルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-

ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、

R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていても

よい、アリール基、

25 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

- 5 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラールキル基；

- 10 (vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-

- 15 ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

- 20 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

- 25 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていても

10 よい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R^{17} は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、

式(V)および式(VI)において、

25 R^{18} は、

(i)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

5 (v) アラルキル基であつて、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ

基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、N,N-

10 ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹(ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

-NHCOR⁹. (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

20 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基：

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロラルキル基であって、該ヘテロ

25 アリール部分が:

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、
5 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

- 10 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

- 15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラールキル基；

(vi)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

- 20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、
 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていても
25 よい、アリール基、

シアノ基、

- アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
5 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
基である)、および
ハロゲン原子
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
10 リール基；
(viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
15 基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基；N, N-
ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、
R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていても
よい、アリール基、
シアノ基、
20 アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
25 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

- (ix) 分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、

式 (V) において、

Wは、脱離能を有する官能基であり、そして

式 (VI) において

- *は、新たに生成する不斉中心を示す、方法。

7. 前記式 (I) で表される化合物の R^7 および R^8 が、それぞれ独立して

(i) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$ のアルキル基；

- (ii) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(iv) アリール基であって、該アリール基が

- 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、

- R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

- シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
- 5 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル
基である)、および
ハロゲン原子
- 10 かなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基；
(v)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、
- 15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ
基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N, N-
ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、
R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていても
よい、アリール基、
- 20 シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
- 25 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル

ハロゲン原子

(vi) - (CH₂)_nOCONR¹⁰R¹¹ (ここで、R¹⁰およびR¹¹はそれぞれ独立して、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基

10 (4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5) アラルキル基であつて、該アラルキル基を構成するアリール部分

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、N,N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、

25 N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基,

—NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

- 5 (6)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリアル部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

- 10 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 N,N -ジ($C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリアル基、

シアノ基、

- 15 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N,N -ジ($C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

- 20 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

- 25 (7)アリアル基であって、該アリアル基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5

10

15

20

25

シアノ基、

- アミド基、
 ニトロ基、
 カルバモイル基、
 N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、
 5 N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、
 -NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル
 キル基である)、および
 ハロゲン原子
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ
 10 テロアリール基、
 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ
 る) ;
 (vii)-(CH₂)_nCONR¹²R¹³ (ここで、R¹²およびR¹³はそれぞ
 れ独立して、
 15 (1)水素原子、
 (2)分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
 (3)アリール基であって、該アリール基が
 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
 分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、
 20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
 トロ基、カルバモイル基、N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基; N,
 N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ
 こで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)で置換されてい
 てもよい、アリール基、
 25 シアノ基、
 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

5 $-\text{NHCO}\text{R}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

10 (4)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₈アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

15 トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,
N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基

20 ニトロ基

カルバモイル基、

N-(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

N, N-ジ(C₁~C₄アルキル)カルバモイル基

25 $-\text{NHCOR}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

- 5 (viii) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^{12} \text{COR}^{13}$ (ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

- 10 分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N-($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)カルバモイル基; N,

N-ジ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-\text{NHCOR}^9$ (こ

- 15 で、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

- 20 カルバモイル基、

N-($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-\text{NHCOR}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、および

- 25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

15 N 、 N -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ
20 テロアリール基、
からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；

(ix) $-(CH_2)_nNR^{12}R^{13}$ （ここで、 R^{12} および R^{13} はそれぞれ独立して、

25 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

5 トロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N ，
 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （こ
で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい
てもよい、アリール基、

シアノ基、

10 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N ， N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル
キル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基、ならびに

20 (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

25 トロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N ，
 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （こ
で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい

てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

15 (x) - (CH₂)_nY-OR¹² (ここで、Yは分岐していてもよいC₁~C₄の二価の飽和炭化水素基であり、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

20 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₆アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ

25 で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

- シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
5 N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル
キル基である)、および
ハロゲン原子
10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア
リール基、ならびに
(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、
分岐していてもよいC₁~C₆アルコキシ基、
15 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ
トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基; N,
N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ
で、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である) で置換されてい
てもよい、アリール基、
20 シアノ基、
アミド基、
ニトロ基、
カルバモイル基、
N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
25 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、
-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

- 5 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xi) $-(CH_2)_n-OR^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、

- 10 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基; N、

- 15 N -ジ($C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

- 20 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アル

- 25 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； N ， N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されてい

10 てもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N ， N -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である）、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は1から12の整数である）；

(xii) $-(CH_2)_n-S-R^{12}$ （ここで、 R^{12} は、

25 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

5 トロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基； N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10 アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

15 $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

20 (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基； N 、

25 N -ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されてい

でもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

15 (xiii) - (CH₂)_n - SO - R¹² (ここで、R¹²は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

20 分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基 ; N,

N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR⁹ (こ

25 てもよい、アリール基、

シアノ基、

25 $-\text{NHCOR}^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ; ならびに

(xiv) $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$ (ここで、 R^{12} は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニ

トロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; N 、

N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (こ

で、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N 、 N -ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC₁~C₄アルキル基、

分岐していてもよいC₁~C₅アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基； N,N -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ （ここで、 R^9 は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基。

10 シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基

15 N, N-ジ (C₁~C₄アルキル) カルバモイル基

-NHCOR⁹ (ここで、R⁹は分岐していてもよいC₁~C₄アルキルである)、および

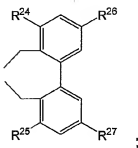
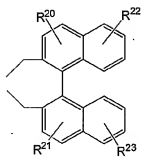
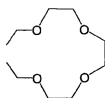
ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) :

からなる群より選択される、一価の有機基であるか、あるいは、

25 R^7 および R^8 が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ （ここで、 m は2から8の整数である）；



(ここで、 R^{20} 、 R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、 R^{25} 、 R^{26} 、および R^{27} はそれぞれ独立して、

水素原子；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_8$ のアルキル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、C₁～C₆のアルケニル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ のアルキニル基；

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_9$ アルコキシ基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキル基で置換されていてもよいアリール基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_6$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール基；

- 5 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_9$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_9$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_9$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

- 10 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_9$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_9$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_9$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール部分を有する、アラルキル基；

- 15 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_9$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_9$ アルキル基で置換されていてもよいアミノ基か、あるいは $C_2 \sim C_9$ を有する環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール部分を有する、ヘテロアラルキル基；

 ($C_1 \sim C_9$ アルコキシ) カルボニル基；

 カルバモイル基；

 N- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；ならびに

- 20 N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基 (ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基は、互いに同じでも異なっているとしてもよい) からなる群より選択される基である) からなる群より選択される二価の有機基である、請求項 6 に記載の方法。

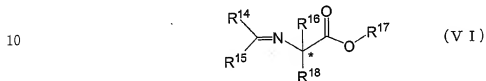
- 25 8. 前記無機塩基水溶液の濃度が 20 w/w% から 70 w/w% である、請求項 6 または 7 に記載の方法。

9. 前記式 (I V) で表される化合物 1 モルに対し、前記式 (I) で表される化合物が、0.01 モル% から 5 モル% の割合で使用される、請求項 6 から 8 のいずれかに記載の方法。

15

10. 光学活性な α -アミノ酸を製造するための方法であつて、

請求項 1～5 のいずれかに記載の方法により得られた式 (VI) で表される化合物：

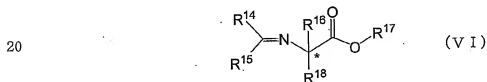


(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様である)を酸で脱イミンする工程；を包含する、方法。

15

11. 光学活性な α -アミノ酸を製造するための方法であつて、

請求項 6～9 のいずれかに記載の方法により得られた式 (VI) で表される化合物：



(ここで、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は上記に定義した基と同様である)を酸で脱イミンする工程；を包含する、方法。

25

